

Rec'd PCT/PTO 06 AUG 2005

特 許 協 力 条 約

PCT

REC'D 03 FEB. 2005

WIPO PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条)
[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 PCT-0401	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2004/001326	国際出願日 (日.月.年) 09.02.2004	優先日 (日.月.年) 10.02.2003
国際特許分類 (IPC) Int. Cl ⁷ C07D211/26, 491/107, 491/20, 401/12, 221/20, A61K31/445, 31/438, 31/4439, A61P43/00, 3/04, 3/10, 5/00, 3/06, 9/06, 35/00, 17/00, 3/00, 15/06, 27/16, 1/16, 9/04, 9/10, 9/12, 13/12, 3/12, 25/18, 25/24, (続き有)		
出願人 (氏名又は名称) 萬有製薬株式会社		

- この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。
法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
- この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 5 ページからなる。
- この報告には次の附属物件も添付されている。
 - ☐ 附属書類は全部で _____ ページである。
 - ☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)
 - ☐ 第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
 - ☐ 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)
- この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- | | | |
|-------------------------------------|--------|--|
| <input checked="" type="checkbox"/> | 第I欄 | 国際予備審査報告の基礎 |
| <input type="checkbox"/> | 第II欄 | 優先権 |
| <input type="checkbox"/> | 第III欄 | 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 |
| <input type="checkbox"/> | 第IV欄 | 発明の単一性の欠如 |
| <input checked="" type="checkbox"/> | 第V欄 | PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 |
| <input checked="" type="checkbox"/> | 第VI欄 | ある種の引用文献 |
| <input type="checkbox"/> | 第VII欄 | 国際出願の不備 |
| <input type="checkbox"/> | 第VIII欄 | 国際出願に対する意見 |

国際予備審査の請求書を受理した日 06.09.2004	国際予備審査報告を作成した日 18.01.2005	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 中木 亜希	4 P 9282
電話番号 03-3581-1101 内線 3492		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

BEST AVAILABLE COPY

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査

☐ PCT規則12.4にいう国際公開

☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に回答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの

第 _____ ページ*、 _____ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ ページ*、 _____ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの

第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの

第 _____ 項*、 _____ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ 項*、 _____ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの

第 _____ ページ/図*、 _____ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ ページ/図*、 _____ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ

☐ 請求の範囲 第 _____ 項

☐ 図面 第 _____ ページ/図

☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____

☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ

☐ 請求の範囲 第 _____ 項

☐ 図面 第 _____ ページ/図

☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____

☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)	請求の範囲	2, 3, 10, 11, 17-32	有 無
	請求の範囲	1, 4-9, 12-16	
進歩性(IS)	請求の範囲	2, 17-29, 32	有 無
	請求の範囲	1, 3-16, 30, 31	
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲	1-32	有 無
	請求の範囲		

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

1. WO 03/004027 A1
2. WO 01/21169 A1

I. 請求の範囲1, 3-16, 30, 31

文献1には、メラニン凝集ホルモン(MCH)拮抗作用を有する種々の化合物が記載されており、Example 329の化合物は、本願一般式[I]において、 R^{3a} , R^{3b} , R^{4a} , R^{4b} , R^{5a} , R^{5b} , R^6 , W^1 及び W^2 が水素原子、 Y^1 , Y^2 , Y^3 及び Y^4 が置換基を有していてもよいメチレン基、かつ、Arがフェニルである化合物に相当する。

医薬に用いられる化合物の技術分野においては、末端の置換基を改変し、医薬として最適又は好適な化合物を得ることはよく行われていることであるから、Example 329の化合物の末端にあるアルキル基を他のアルキル基に変更したり、アリールであるフェニル基を、文献1に該基と同等の置換基として記載されているヘテロアリールに置換してみることは、当業者であれば容易に成し得たことと認められる。

以上から、本願請求の範囲1, 4-9, 12-16に記載された発明は、文献1により新規性及び進歩性を有さず、そして、本願請求の範囲3, 10, 11, 30及び31に記載された発明は、文献1より進歩性を有しない。

II. 請求の範囲2, 17-29, 32

文献1及び2には、MCH拮抗作用を有するピペリジン誘導体が記載されているが、文献1及び2のいずれにも、該誘導体が、本願一般式[I-1]で表される化学構造を有することは記載も示唆もされておらず、また、該化学構造を有する化合物に想到することが当業者にとって自明であったとも認められない。

以上から、本願請求の範囲2, 17-29及び32に記載された発明は、文献1及び2に対して新規性及び進歩性を有する。

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 2004/004714 A1 [EX]	15. 01. 2004	03. 07. 2003	03. 07. 2002

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

国際特許分類 (IPC) の続き

Int. Cl⁷ A61P25/22, 25/08, 25/28, 25/20, 25/14, 25/30, 25/32, 25/36, 15/00, 15/10,
1/00, 27/00, 25/02, 11/00

Rec'd PCT/PTO 03 AUG 2005

PCT/JP2004/001326



Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference PCT-0401	FOR FURTHER ACTION		See Form PCT/IPEA/416
International application No. PCT/JP2004/001326	International filing date (day/month/year) 09 February 2004 (09.02.2004)	Priority date (day/month/year) 10 February 2003 (10.02.2003)	
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D211/26,491/107,491/20,401/12,221/20,A61K31/445,31/438,31/4439,A61P43/00,3/04,3/10,5/00,3/06,9/06,35/00,17/00,3/00,15/06,27/16,1/16,9/04,9/10,9/12,13/12,3/12,25/18,25/24 (SEE SUP. SHEET)			
Applicant BANYU PHARMACEUTICAL CO.,LTD.			

1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet.
3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:
 - a. ☐ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of _____ sheets, as follows:
 - ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).
 - ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.
 - b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) _____, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).

4. This report contains indications relating to the following items:
 - ☒ Box No. I Basis of the report
 - ☐ Box No. II Priority
 - ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
 - ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
 - ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
 - ☒ Box No. VI Certain documents cited
 - ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
 - ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 06 September 2004 (06.09.2004)	Date of completion of this report 18 January 2005 (18.01.2005)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/001326

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

- ☐ This report is based on translations from the original language into the following language _____, which is language of a translation furnished for the purpose of:
- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
 - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
 - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

- ☒ The international application as originally filed/furnished
- ☐ the description:
- pages _____, as originally filed/furnished
- pages* _____ received by this Authority on _____
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☐ the claims:
- pages _____, as originally filed/furnished
- pages* _____, as amended (together with any statement) under Article 19
- pages* _____ received by this Authority on _____
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☐ the drawings:
- pages _____, as originally filed/furnished
- pages* _____ received by this Authority on _____
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/figs _____
- ☐ the sequence listing (*specify*): _____
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/figs _____
- ☐ the sequence listing (*specify*): _____
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**1. Statement**

Novelty (N)	Claims	2, 3, 10, 11, 17-32	YES
	Claims	1, 4-9, 12-16	NO
Inventive step (IS)	Claims	2, 17-29, 32	YES
	Claims	1, 3-16, 30, 31	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-32	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations (Rule 70.7)

Document 1: WO, 03-004027, A1

Document 2: WO, 01-21169, A1

I. Claims 1, 3-16, 30 and 31

Document 1 describes various compounds having melanin-concentrating hormone (MCH) antagonism, and the compound of Example 329 corresponds to a compound represented by the general formula [I] of the present application, where R^{3a} , R^{3b} , R^{4a} , R^{4b} , R^{5a} , R^{5b} , R^6 , W^1 and W^2 denote respectively a hydrogen atom; Y^1 , Y^2 , Y^3 and Y^4 denote respectively a methylene group having or not having a substituent group, and Ar denotes phenyl.

In the technical field of compounds used for drugs, it is often practiced to modify the substituent groups at the ends for obtaining a compound most suitable or suitable as a drug. So, a person skilled in the art could have easily (1) changed the alkyl group at an end of the compound of Example 329 into another alkyl group and (2) substituted a phenyl group as an aryl group by a heteroaryl group described as a substituent group equivalent to the said group in document 1.

From the above, the subject matters of claims 1, 4-9 and 12-16 of the present application do not appear to be novel or to involve an inventive step in view of document 1, and the subject matters of claims 3, 10, 11, 30 and 31 of the present application do not appear to involve an inventive step in view of document 1.

II. Claims 2, 17-29 and 32

Documents 1 and 2 respectively describe a piperidine derivative having MCH antagonism, but neither document 1 nor document 2 describes or suggests that the said derivative has the chemical structure represented by the general formula [I-1] of the present application. Furthermore, it is not considered to be obvious for a person skilled in the art to conceive of compounds having the said chemical structure.

From the above, the subject matters of claims 2, 17-29 and 32 of the present application appear to be novel and to involve an inventive step in view of documents 1 and 2.

Box No. VI Certain documents cited

1. Certain published documents (Rule 70.10)

Application No. Patent No.	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/year)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
WO 2004/004714 A1 [E, X]	15.01.2004	03.07.2003	03.07.2002

2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

Kind of non-written disclosure	Date of non-written disclosure (day/month/year)	Date of written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year)

Supplemental Box

In case the space in any of the preceding boxes is not sufficient.

Continuation of: IPC

Int. Cl.⁷

A61P25/22, 25/08, 25/28, 25/20, 25/14, 25/30, 25/32, 25/36, 15/00, 15/10,
1/00, 27/00, 25/02, 11/00

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.